

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.**

THIS PAGE BLANK (USPTO)

採用

ライオン, 分枝脂肪酸, PA

⑨ 日本国特許庁(JP)

⑩ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A)

昭61-7205

14

⑪ Int. Cl.

A 61 K 7/00
7/06

識別記号

庁内整理番号

7306-4C
8115-4C

⑬ 公開 昭和61年(1986)1月13日

審査請求 有 発明の数 1 (全8頁)

⑭ 発明の名称 細胞賦活剤

⑮ 特 願 昭59-128198

⑯ 出 願 昭59(1984)6月21日

⑰ 発 明 者 足 立 邦 明 神奈川県足柄上郡松田町惣領423の5
 ⑰ 発 明 者 豊 野 保 之 山原市中曾根329の1
 ⑰ 発 明 者 定 井 止 直 平塚市札幌町39の2
 ⑰ 発 明 者 大 場 健 吉 船橋市高根台3の34の16
 ⑱ 出 願 人 ライオン株式会社 東京都墨田区本所1丁目3番7号
 ⑲ 代 理 人 弁理士 鈴江 武彦 外2名

皮膚賦活
細胞賦活剤 [養毛]

分枝脂肪酸

明 細 書

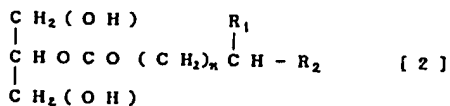
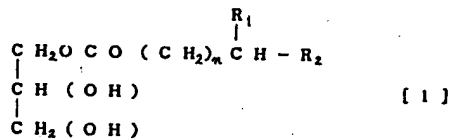
1. 発明の名称

細胞賦活剤

2. 特許請求の範囲

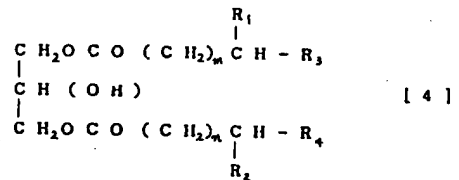
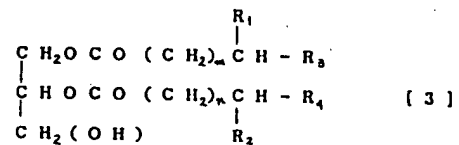
1. 皮膚また毛髪用の化粧品に配合使用される
分枝脂肪酸またはその誘導体からなる細胞賦活
剤。

2. 上記脂肪酸の誘導体は、下記構造式〔1〕
または〔2〕で示されるモノグリセライドであ
る。特許請求の範囲第1項の細胞賦活剤。



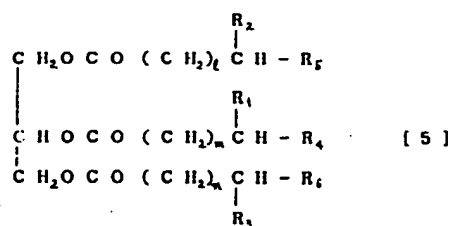
(式中、nは0または偶数を表し、R₁及びR₂
は同一または異なる直鎖式有機基を表す。)

3. 上記脂肪酸の誘導体は、下記構造式〔3〕
または〔4〕で示されるジグリセライドである。
特許請求の範囲第1項の細胞賦活剤。



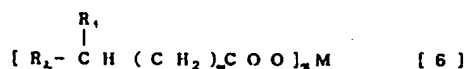
(式中、mまたはnは0または偶数を表し、R₁
ないしR₄は同一または異なる直鎖式有機基を表す。
)

4. 上記脂肪酸の誘導体は、下記構造式〔5〕
で示されるトリグリセライドである。特許請求の
範囲第1項の細胞賦活剤。



(式中、l、mまたはnは0または偶数を表し、 R_1 、 R_4 、 R_5 または R_6 は同一または異なる直鎖式有機基を表す。)

5. 上記脂肪酸の誘導体は、下記構造式[6]で示される脂肪酸塩である、特許請求の範囲第1項の細胞賦活剤。



(式中、mは0または偶数を表し、 R_1 または R_2 は同一または異なる直鎖式有機基、Mは金属原子、nはMの価数に対応した整数を表す。)

6. 上記脂肪酸の誘導体は、下記構造式[7]で示されるエステルである、特許請求の範囲第1項の細胞賦活剤。



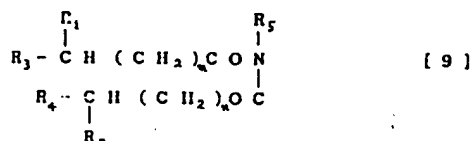
(式中、nは0または偶数を表し、 R_1 または R_2 は同一または異なる直鎖式有機基、 R_3 は1価または2価のアルコール残基、アミン残基、ポリオキシエチレン残基、ソルビタン残基またはシロキシ残基を表す。)

7. 上記脂肪酸の誘導体は、下記構造式[8]で示される第1アミドである、特許請求の範囲第1項の細胞賦活剤。



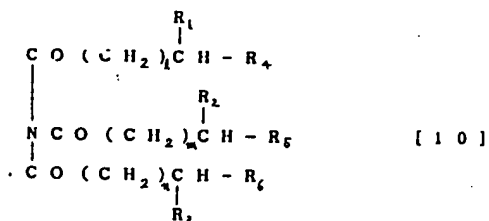
(式中、nは0または偶数を表し、 R_1 または R_2 は同一または異なる直鎖式有機基、 R_3 または R_4 は水素または同一または異なる直鎖式有機基を表す。)

8. 上記脂肪酸の誘導体は、下記構造式[9]で示される第2アミドである、特許請求の範囲第1項の細胞賦活剤。



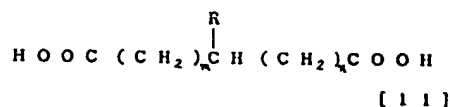
(式中、mまたはnは0または偶数を表し、 R_1 、 R_3 、 R_4 または R_5 は同一または異なる直鎖式有機基を表す。)

9. 上記脂肪酸の誘導体は、下記構造式[10]で示される第3アミドである、特許請求の範囲第1項の細胞賦活剤。



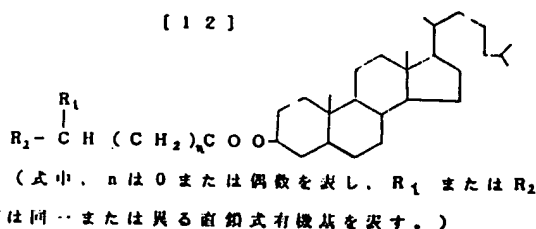
(式中、l、mまたはnは0または偶数を表し、 R_1 、 R_3 、 R_4 または R_6 は同一または異なる直鎖式有機基を表す。)

10. 上記脂肪酸の誘導体は、下記構造式[11]



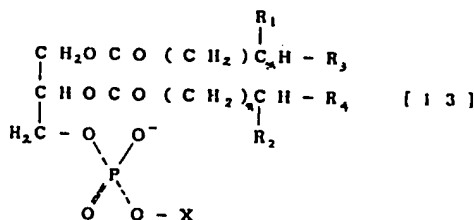
(式中、mまたはnは0または偶数を表し、Rは直鎖式有機基を表す。)

11. 上記脂肪酸の誘導体は、下記構造式[12]で示されるステロールエステルである、特許請求の範囲第1項の細胞賦活剤。



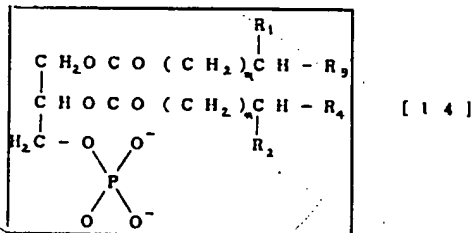
12. 上記脂肪酸の誘導体は、下記構造式[13]で示されるリン脂質である、特許請求の範囲第1項の細胞賦活剤。

1]で示される二塩基酸及びその塩である、特許請求の範囲第1項の細胞賦活剤。



(式中、mまたはnは0または偶数を表し、R₁ないしR₄は直鎖式有機基、Xはコリン残基、エタノールアミン残基、セリン残基またはイノシトール残基を表す。)

13. 上記脂肪酸の誘導体は、下記構造式[14]で示される**フォスファチジン酸**である、特許請求の範囲第1項の細胞賦活剤。



7

れることを特徴とする、特許請求の範囲第1項乃至第15項のいずれかひとつの細胞賦活剤。

17. 化粧品中に0.01重量%以上のビオチン及びビタミンB12と共に使用されることを特徴とする、特許請求の範囲第1項乃至第16項のいずれかひとつの細胞賦活剤。

3. 発明の詳細な説明

技術分野

本発明は化粧品に配合されて使用される細胞賦活剤に関する。

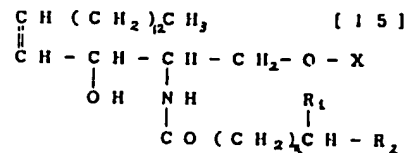
従来技術

皮膚の賦活効果を目的とした皮膚化粧品及び皮膚賦活効果の結果として皮膚付属器官のひとつである毛髪の成長を促す養毛料のような毛髪化粧品は従来から数多く知られている。

これらの化粧品には皮膚賦活剤効果を与えるための有効成分として、ビタミンEなどのビタミン類、セリン、メチオニンなどのアミノ酸類、アセチルコリン誘導体などの血管拡張剤、エストラジオール、セファラチンなどの皮膚機能亢進剤、及

(式中、mまたはnは0または偶数を表し、R₁ないしR₄は直鎖式有機基を表す。)

14. 上記脂肪酸の誘導体は、下記構造式[15]で示されるスフィンゴ脂質である、特許請求の範囲第1項の細胞賦活剤。



(式中、nは0または偶数を表し、R₁及びR₂は直鎖式有機基、Xは糖残基、リン酸残基またはアミン塩残基を表す。)

15. 上記分枝脂肪酸はα-メチルオクタデカン酸、α-メチルウンデカン酸、β-プロピルウンデカン酸、α-メチルステアリン酸、α-メチルパルミチン酸、α-またはγ-メチルノナン酸、δ-エチルトリデカン酸からなる群から選択される少なくともひとつの酸である、特許請求の範囲第1項の細胞賦活剤。

16. 化粧品中に、0.10重量%以上含有さ

8

び皮膚の保湿性を高めることにより皮膚生理機能を亢進させる成分としてピロリドンカルボン酸などが含有されている。また、養毛料等の化粧品に配合された脂肪酸の例としては、皮膚成分の補給もしくは製品の物性を改善する等の目的でオリーブ油、ヒマシ油等の天然脂肪油、あるいはステアリン酸、パルミチン酸、ミスチリン酸及びそれらの誘導体が知られている。

しかし、これらの皮膚賦活剤は生体の生理機能を亢進する上でまだ十分な効果を有するものではない。そこで、皮膚用及び毛髪用化粧品に少量配合されて優れた皮膚賦活効果を与える物質の提供が望まれている。

発明の構成

本発明の目的は化粧品に少量配合されて、十分な皮膚賦活効果または養毛効果を奏する細胞賦活剤を提供することである。

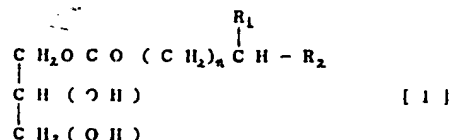
皮膚及びその付属器官である毛髪の賦活化において最も重要なことは細胞内のエネルギー代謝の亢進にある点に着目して本発明を完成したもので

ある。

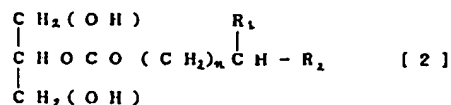
即ち、本発明は、皮膚用及び毛髪用化粧品に混合使用される分枝脂肪酸またはその誘導体からなる細胞賦活剤を提供する。

本発明に使用される好ましい分枝脂肪酸の誘導体は、例えば、

下記構造式のモノグリセライド；



または



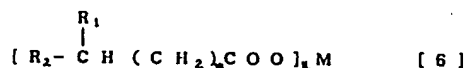
(式中、nは0または偶数を表し、R₁及びR₂は同一または異なる直鎖式有機基を表す。R₁及びR₂はメチル基またはプロピル基が好ましい。)

下記構造式のジグリセライド；

11

(式中、l、mまたはnは0または偶数を表し、R₁ないしR₆は同一または異なる直鎖式有機基を表す。R₁ないしR₃はメチル基またはプロピル基が好ましい。l = m = n = 0で、R₁ = R₂ = R₃ = メチル基、R₄ = R₅ = R₆ = ウンデカノイル基の場合には、トリα-メチルウンデカノイルに相当する。)

下記構造式の脂肪酸塩；

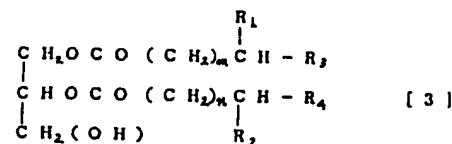


(式中、mは0または偶数を表し、R₁またはR₂は同一または異なる直鎖式有機基、Mは金属原子、nはMの価数に対応した整数を表す。R₁はメチル基またはプロピル基が好ましい。m = 2、n = 1で、R₁ = メチル基、R₂ = ノニル基、M = ナトリウムの場合には、γ-メチルノナン酸ナトリウムに相当する。)

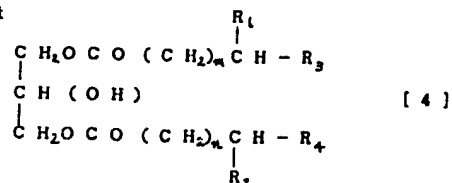
下記構造式のエステル；



13

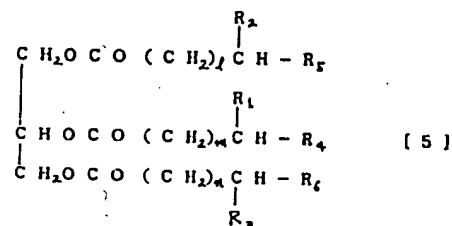


または



(式中、mまたはnは0または偶数を表し、R₁ないしR₄は同一または異なる直鎖式有機基を表す。R₁及びR₂はメチル基またはプロピル基が好ましい。)

下記構造式のトリグリセライド；



12

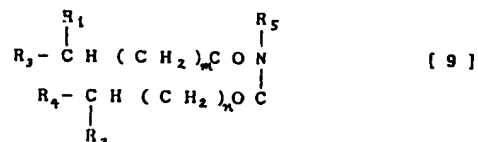
(式中、nは0または偶数を表し、R₁またはR₂は同一または異なる直鎖式有機基、R₃は1価または2価のアルコール残基、アミン残基、ポリオキシエチレン残基、ソルビタン残基またはシロキサン残基を表す。R₁はメチル基またはプロピル基が好ましい。)

下記構造式の第1アミド；



(式中、nは0または偶数を表し、R₁またはR₂は同一または異なる直鎖式有機基、R₃またはR₄は水素または同一または異なる直鎖式有機基を表す。R₁はメチル基またはプロピル基が好ましい。)

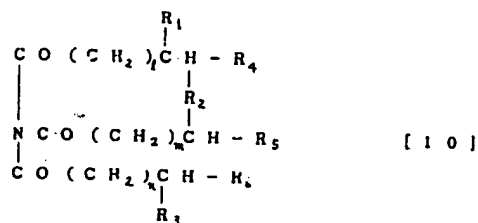
下記構造式の第2アミド；



(式中、mまたはnは0または偶数を表し、R₁ないしR₄は同一または異なる直鎖式有機基、R₅

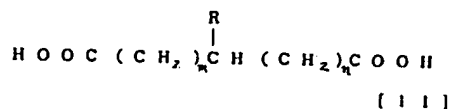
は水基または同一または異なる直鎖式有機基を表す。 R_1 及び R_2 はメチル基またはプロピル基が好ましい。))

下記構造式の第3アミド:



(式中、 l 、 m または n は0または偶数を表し、 R_1 ないし R_5 は同一または異なる直鎖式有機基を表す。 R_1 ないし R_3 はメチル基またはプロピル基が好ましい。)

下記構造式の二塩基酸及びその塩:

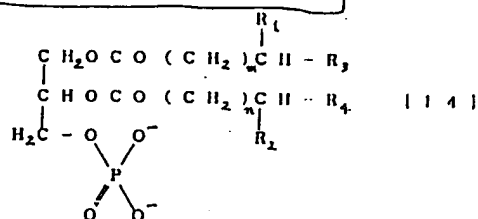


(式中、 m または n は0または偶数を表し、 R は直鎖式有機基を表す。 R はメチル基またはプロ

15

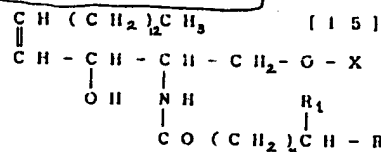
ピル基を表す。 R_1 及び R_2 はメチル基またはプロピル基が好ましい。)

下記構造式のフォスファチジン酸:



(式中、 m または n は0または偶数を表し、 R_1 ないし R_4 は直鎖式有機基を表す。 R_1 及び R_2 はメチル基またはプロピル基が好ましい。)

下記構造式のスフィンゴ脂質:



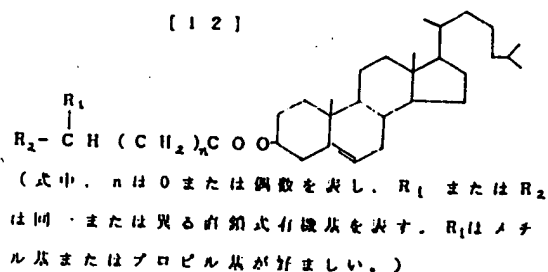
(式中、 n は0または偶数を表し、 R_1 及び R_2 は直鎖式有機基、 X は糖残基、リン酸残基またはアミン塩残基を表す。 R_1 はメチル基またはプロピ

17

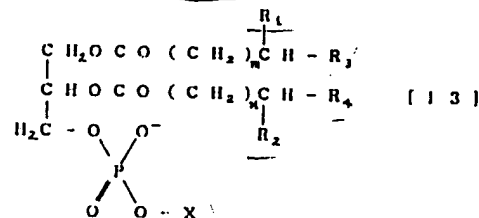
ピル基が好ましい。)

下記構造式のステロールエステル:

[12]



下記構造式のリン脂質:



(式中、 m または n は0または偶数を表し、 R_1 ないし R_4 は直鎖式有機基、 X はコリン残基、エタノールアミン残基、セリン残基またはイノシ

16

ル基が好ましい。)

また好ましい分枝脂肪酸には α -メチルオクタデカン酸、 α -メチルウンデカン酸、 β -プロピルウンデカン酸、 α -メチルステアリン酸、 α -メチルパルミチン酸、 α -または γ -メチルノナン酸、 δ -エチルトリデカン酸などがある。

本発明の細胞賦活剤は常法に従って化粧品中に配合される。本文中で化粧品とは、皮膚用のスキンケアクリーム、スキンローション等、及び毛髪用のヘアトニック、ヘアローション、ヘアクリーム、シャンプー、リンス、美毛料等を意味する。

これらの化粧品中に含まれる他の成分は、通常これらの製造に使用されるものでよく、例えば基材としての蒸留水、一価または多価アルコール類、界面活性剤、油脂類などであり、更に薬効成分としてビタミン類、ホルモン類、血管拡張剤、アミノ酸類、抗炎症剤、角質溶解剤などの既知のものを同時に配合しえる。

本発明の細胞賦活剤は化粧品中に0.10%以上含まれることが好ましい。しかし、この濃度が高

--33--

18

くなるほど皮膚に刺激を与え易くなるので、この点から100%以下であることが好ましい。更に、細胞賦活剤と共にビオチン及び/またはビタミンB12を配合すれば、一層小さい濃度の細胞賦活剤で同様の効果を得ることができることが判明した。

以下に本発明の細胞賦活剤を配合したいくつかの化粧品の配合例を示す。

配合例1：養毛料

成分	含量(重量%)
80%エタノール	88.0
α-メチルステアリン酸	10.0
ヒマシ油	1.0
ピロリドンカルボン酸	0.5
香料	0.5

配合例2：養毛料

成分	含量(重量%)
80%エタノール	97.8
トリα-メチルウンデカノイン	0.1

19

配合例5：シャンプー

成分	含量(重量%)
ラウリルエーテル	
硫酸ナトリウム	5.0
α-オレフィン	
スルホン酸ナトリウム	10.0
ラウリル硫酸	
トリエタノールアミン	5.0
γ-メチルノナン酸ナトリウム	3.0
精製水	77.0

配合例6：ヘアリンス

成分	含量(重量%)
塩化ステアリル	
トリメチルアンモニウム	1.5
塩化ジステアリル	
ジメチルアンモニウム	0.5
セタノール	1.5
ポリオキシエチレン	
ステアリルエーテル(p=5)	2.0
流動パラフィン	1.0

21

特開昭61-7205(6)

オリーブ油	1.0
α-トコフェノール	0.5
香料	0.5
ビオチン	0.05
ビタミンB12	0.05

配合例3：養毛料

成分	含量(重量%)
90%エタノール	92.5
γ-メチルノナン酸ナトリウム	5.0
オリーブ油	1.0
グリチルリチン	1.0
香料	0.5

配合例4：スキนครリーム

成分	含量(重量%)
α-メチルオクタデカン酸	10.0
オリーブ油	5.0
流動パラフィン	51.0
ミツロウ	1.0
ソルビタンセスキオレート	3.0
精製水	30.0

20

トリα-メチルウンデカノイン	3.0
精製水	90.5

配合例7：ヘアクリーム

成分	含量(重量%)
α-メチルステアリン酸	10.0
オリーブ油	5.0
流動パラフィン	51.0
ミツロウ	1.0
ソルビタンセスキオレート	3.0
精製水	30.0

配合例8：ヘアトニック

成分	含量(重量%)
γ-メチルノナン酸ナトリウム	3.0
トウガラシチンキ	0.5
ヒノキチオール	0.1
α-トコフェノール	0.3
ヒマシ油	10.0
エチルアルコール	86.1

本発明に関わる分枝脂肪酸及びその誘導体から

-34-

22

選ばれたいくつかの細胞賦活剤について、皮膚の細胞に対する賦活効果を皮膚の水分保持能及び皮膚血流量の測定により試験した。この試験に使用した物質はα-メチルオクタデカン酸、トリα-メチルウンデカノイン、γ-メチルノナン酸ナトリウム、並びにこれらと類似の化学構造を有するトリβ-プロピルウンデカノインひる-エチルトリデカン酸エチルであり、ビオチン及びビタミンB12も上記物質と併用してその相乗効果を試験した。

試験方法は以下のとおりである：まず、上記の被験物質をエタノールに溶解して被験試料を調製した。平常人の前腕部位を軽く石鹸で洗淨して皮膚を除去し、1時間後に平常時の皮膚の電気伝導度及び血流量を測定した。皮膚の伝導度の値は皮膚が保持する水分量に比例している事から皮膚水分保持能の評価に用いた。次に、各被験試料を1日4回の割合で2週間連続して平常人の前腕部位に塗布した。最終塗布後2時間後に塗布部位を石鹸で洗淨し、更にその1時間後に皮膚の伝導度及

び血流量を測定して、平常時の値を100とした場合の増加率(%)を被験物質の濃度(重量%)とともに第1表に示した。

この表から、本発明の分枝脂肪酸及びその誘導体は類似の化学構造を有する他の脂肪酸またはその誘導体に比べ顕著な細胞賦活効果を有することが明らかである。また、ビオチン及びビタミンB12を同時に使用すれば、本発明の細胞賦活剤の濃度を約1/5にしても同程度またはそれ以上の効果が得られることがわかる。

更に、皮膚の付属器官である毛髪の成長をつかさどる毛根細胞に対する賦活効果についても試験した。即ち、本発明の細胞賦活剤を配合したヘアトニック、例えば上記配合例8、を調製し、若年性脱毛症患者25名に使用した。使用期間は6箇月とし、この期間中は被験者全員に上記ヘアトニック以外の頭髮化粧料及び養毛料の使用を禁止した。この試験の結果、被験者25名中19名に頭髮の成長がみられるなどの有効性が確認された。

尚、本発明の細胞賦活剤を使用することによる副作用は全く認められない。本発明の細胞賦活剤を配合した上記配合例の化粧品を平常人25名に適用して、クローズドバッチシステムによる皮膚刺激性試験を行なつたところ、結果はいずれも陰性であった(陽性率0%)。この様に本発明の細胞賦活剤はいずれも安全性の高いものである。

第 1 表

試 験 物 質	濃 度 (重量%)	皮膚水分保持能		皮下血流量		総合判定
		増加率	効果	増加率	効果	
<u>α-メチルオクタデカン酸</u>	0.5	146%	著効	168%	著効	<u>有効</u>
<u>トリα-メチルウンデカノイン</u>	0.5	162%	著効	180%	著効	<u>有効</u>
<u>γ-メチルノナン酸ナトリウム</u>	0.5	144%	著効	151%	著効	<u>有効</u>
<u>α-メチルオクタデカン酸</u>	0.1					
ビオチン	0.01	176%	著効	198%	著効	<u>有効</u>
<u>ビタミンB12</u>	0.01					
<u>トリα-メチルウンデカノイン</u>	0.1					
ビオチン	0.01	139%	著効	187%	著効	<u>有効</u>
<u>ビタミンB12</u>	0.03					
<u>γ-メチルノナン酸ナトリウム</u>	0.1					
ビオチン	0.03	141%	著効	186%	著効	<u>有効</u>
<u>ビタミンB12</u>	0.01					
<u>トリβ-プロピルウンデカノイン</u>	0.5	100%	無	109%	無	無効 ✓
<u>δ-エチルトリデカン酸エチル</u>	0.5	96%	無	91%	無	無効 ✓

DIALOG(R)File 352:Derwent WPI
(c) 2001 Derwent Info Ltd. All rts. reserv.

004549491

WPI Acc No: 1986-052835/198608

Cellular activity for use in skin and hair cosmetics - comprising
branched fatty acid or its deriv.

Patent Assignee: LION CORP (LIOY)

Number of Countries: 001 Number of Patents: 001

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week
JP 61007205	A	19860113	JP 84128198	A	19840621	198608 B

Priority Applications (No Type Date): JP 84128198 A 19840621

Patent Details:

Patent No	Kind	Lan Pg	Main IPC	Filing Notes
JP 61007205	A	8		

Abstract (Basic): JP 61007205 A

New cellular activators comprise a branched fatty acid or its
deriv.

Pref. the fatty acid deriv. is a monoglyceride of formula (I) or
(II). n is 0 or an even number. R1 and R2 are each a straight chained
organic gp.

The branched fatty acid (deriv.) may be a diglyceride or
triglyceride of the fatty acid, salt of the fatty acid, ester of the
acid, prim. amide, sec. amide, tert.-amide of the fatty acid, dibasic
acid or its salts, sterol ester of the fatty acid, phospholipid of the
fatty acid, phosphatidic acid, sphingolipid, alpha-methyloctadecanoic
acid, alpha-methylundecanoic acid, beta-propylundecanoic acid,
alpha-methylstearic acid, alpha-methylpalmitic acid, alpha or
gamma-methylnonanoic acid, delta-ethyltridecanoic acid etc. (8pp
Dwg.No.0/0)

Derwent Class: D21; E17

International Patent Class (Additional): A61K-007/00

THIS PAGE BLANK (USPTO)